

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM
GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

REC'D 17 SEP 2004

WIPO PCT

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000053897	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/09513	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 28.08.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 04.09.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07C213/00		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. Dieser Internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der Internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.



2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

- ☒ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt 3 Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Bescheids
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 23.03.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 14.09.2004
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - Gitschiner Str. 103 D-10958 Berlin Tel. +49 30 25901 - 0 Fax: +49 30 25901 - 840	Bevollmächtigter Bediensteter Rufet, J Tel. +49 30 25901-332 

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

Beschreibung, Seiten

1-9 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10 eingegangen am 13.08.2004 mit Schreiben vom 04.08.2004

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)

Ja: Ansprüche 1-10

Nein: Ansprüche

Erfinderische Tätigkeit (IS)

Ja: Ansprüche 1-10

Nein: Ansprüche

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)

Ja: Ansprüche: 1-10

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

- D1: WO 99 38824 A in der Anmeldung erwähnt
- D2: WO 99 38613 A in der Anmeldung erwähnt
- D3: WO 99 38838 A in der Anmeldung erwähnt
- D4: WO 98 52891 A in der Anmeldung erwähnt
- D5: EP-A-0 589 168
- D6: DE 27 15 666 A
- D7: EP-A-1 112 776

1. Neuheit

Die Entgegenhaltungen D1-D3 beschreiben ebenfalls ein Verfahren zur Herstellung optisch aktiver 2-Amino- oder 2-Hydroxy-1-Alkanole durch Hydrierung entsprechender optisch aktiver 2-Amino- oder 2-Hydroxycarbonsäuren oder ihrer Säurederivate.

Der Anmeldungsgegenstand unterscheidet sich vom Stand der Technik D1-D3 durch die Natur des Katalysators (Pd-Re oder Pd-Re statt Ru-Re in D1-D3).

Die Entgegenhaltungen D4-D7 beschreiben Verfahren zur Herstellung von Alkoholverbindungen, die keine optisch aktive Verbindungen sind, durch katalytische Hydrierung entsprechender Carbonsäuren in Gegenwart von Palladium und Rhenium (D5, D6, D7) oder Platin und Rhenium (D4, D6).

Der Anmeldungsgegenstand kann somit als neu angesehen werden.

2. Erfinderische Tätigkeit

2.1 Der Anmeldung ist folgende, der Erfindung zugrunde liegende Aufgabe zu entnehmen (siehe Beschreibung Seite 2, Z. 15-21): Es soll ein verbessertes Verfahren (hohe Aktivität des Katalysators sowie hohe Enantiomerenüberschüsse) zur Herstellung optisch aktiver 2-Amino-, 2-Chlor-, 2-Hydroxy oder 2-Alkoxy-1-Alkanole bereitgestellt werden.

2.2 D1-D3 sind für die Beurteilung der erfinderischen Tätigkeit relevant und als nächster Stand der Technik zu betrachten. Diese Dokumente offenbaren ebenfalls

Verfahren zur Herstellung optisch aktiver 2-Amino- oder 2-Hydroxy-1-Alkanole mit hohen Enantiomerenüberschüssen und lösen damit die anmeldungsgemäße Aufgabe.

2.3 Daher ist die Aufgabe in der Bereitstellung von weiteren verbesserten Verfahren zur Herstellung optisch aktiver 2-Amino-, 2-Chlor-, 2-Hydroxy oder 2-Alkoxy-1-Alkanole zu sehen.

2.4 Aufgrund der Beispiele und Vergleichsbeispiele (siehe insbesondere S. 8-9) ist es glaubhaft, daß diese Aufgabe (Punkt 2.3) mit den in Anspruch 1 enthaltenen technischen Verfahrensmaßnahmen gelöst wurde.

2.5 Die Lösung dieser Aufgabe gemäß Ansprüche 1-10 ist aufgrund des Standes der Technik D1-D3 sowie D4-D7 als überraschend anzusehen.

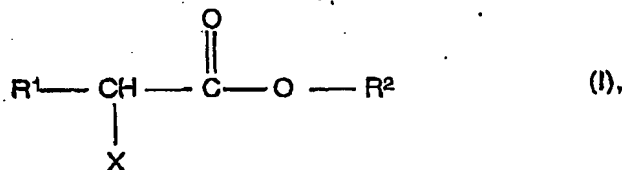
Zwar erhält der Fachmann aus dem Stand der Technik D1-D3 den Hinweis, daß die Verwendung eines Ruthenium/Rhenium Katalysators für die Herstellung optisch aktiver 2-Amino- oder 2-Hydroxy-1-Alkanole durch Hydrierung entsprechender optisch aktiver 2-Amino- oder 2-Hydroxycarbonsäuren ebenfalls zur hohen Enantiomerenüberschüssen führt.

Aus dem Stand der Technik D1-D3 sowie D4-D7 erhält der Fachmann jedoch keinerlei Hinweise Ruthenium durch Palladium oder Platin zu ersetzen, wenn er einen weiteren effektiven Katalysator für die Herstellung **optisch aktiver** 2-Amino-, 2-Chlor-, 2-Hydroxy oder 2-Alkoxy-1-Alkanole aus entsprechender optisch aktiver 2-Amino- oder 2-Hydroxycarbonsäuren bereitstellen wollte, da die Verfahren gemäß D4-D7 **nicht** zur Herstellung von optisch aktiven Alkoholverbindungen führen.

Der Anmeldungsgegenstand erfüllt somit das Erfordernis von Regel 33(3) PCT.

filed
Patentansprüche

1. Verfahren zur Herstellung optisch aktiver 2-Amino-, 2-Chlor-,
5 2-Hydroxy- oder 2-Alkoxy-1-Alkanole durch katalytische
Hydrierung entsprechender optisch aktiver 2-Amino-, 2-Chlor-,
2-Hydroxy- und 2-Alkoxycarbonsäuren oder ihrer Säurederivate,
dadurch gekennzeichnet, dass man die Hydrierung in Gegenwart
10 von Palladium und Rhenium oder Platin und Rhenium ent-
haltenden Katalysatoren durchführt.
2. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man
optisch aktive 2-Amino-, 2-Chlor-, 2-Hydroxy- oder 2-Alkoxy-
carbonsäuren oder deren Ester der Formel I,



in der die Reste folgende Bedeutung haben:

- 25 R^1 : Geradkettiges oder verzweigtes C_1 - C_{12} -Alkyl,
 C_7 - C_{12} -Aralkyl oder C_6 - C_{10} -Aryl, wobei die genannten
Reste durch NR^3R^4 , OH, COOH und/oder weitere, unter den
Reaktionsbedingungen stabile Gruppen substituiert sein
können,
- 30 R^2 : Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C_1 - C_{12} -Alkyl
oder C_3 - C_8 -Cycloalkyl,
- X : Chlor, NR^5R^6 oder OR^7 ,
- 35 R^3 , R^4 , R^5 und R^6 :
Unabhängig voneinander jeweils Wasserstoff, geradkettiges
oder verzweigtes C_1 - C_{12} -Alkyl, C_7 - C_{12} -Aralkyl, C_6 - C_{10} -Aryl,
 C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder C_3 - C_8 -Cycloalkyl, in dem eine
40 CH_2 -Gruppe durch O oder NR^8 ersetzt ist.
- R^3 und R^4 sowie R^5 und R^6 :
Unabhängig voneinander jeweils gemeinsam auch $-(\text{CH}_2)_m-$,
wobei m eine ganze Zahl von 4 bis 7 bedeutet,

R¹ und R⁵:

Gemeinsam auch $-(CH_2)_n-$, wobei n einer ganzen Zahl von 2 bis 6 entspricht,

5 R⁷: Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl oder C₃-C₈-Cycloalkyl,

R¹ und R⁷:

10 Gemeinsam auch $-(CH_2)_n-$, wobei n einer ganzen Zahl von 2 bis 6 entspricht und

R⁸: Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₁₂-Alkyl, C₇-C₁₂-Aralkyl oder C₆-C₁₀-Aryl,

15 oder deren Säureanhydride einsetzt und zu den entsprechenden optisch aktiven Alkoholen hydriert.

21 (siehe Beiblatt)

3. Verfahren nach den Ansprüchen 1 und 2, dadurch gekennzeichnet, dass die Palladium/Rhenium- oder Platin/Rhenium-Katalysatoren mindestens ein Element aus der Gruppe der
20 Elemente Titan, Vanadium, Chrom, Mangan, Eisen, Kobalt, Nickel, Kupfer, Zink, Zirkon, Molybdän, Silber, Zinn, Wolfram, Blei, Lanthan und Cer enthalten.

25 4. Verfahren nach den Ansprüchen 1 und 2, dadurch gekennzeichnet, dass die Palladium/Rhenium- oder Platin/Rhenium-Katalysatoren mindestens ein Element aus der Gruppe der Elemente Silber, Molybdän, Wolfram oder Zinn enthalten.

30 5. Verfahren nach den Ansprüchen 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass die Palladium/Rhenium- oder Platin/Rhenium-Katalysatoren ungeträgert oder auf einen Träger aufgebracht eingesetzt werden.

35 6. Verfahren nach den Ansprüchen 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass das Gewichtsverhältnis der Elemente Palladium oder Platin zu Rhenium 100:1 bis 0,01:1 beträgt.

40 7. Verfahren nach den Ansprüchen 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, dass das Gewichtsverhältnis der Elemente Palladium oder Platin zu Rhenium 50:1 bis 0,05:1 beträgt.

45 8. Verfahren nach den Ansprüchen 1 bis 7, dadurch gekennzeichnet, dass das Gewichtsverhältnis der Elemente Palladium oder Platin zu dem mindestens einen weiteren Element des Katalysators 100:1 bis 10:1 beträgt.

WO 2004/022522

+49 621 6021183

PCT/EP2003/009513

12

9. Verfahren nach den Ansprüchen 1 bis 8, dadurch gekennzeichnet, dass man die Hydrierung in Gegenwart einer Säure durchführt.

5 10. Verfahren nach den Ansprüchen 1 bis 9, dadurch gekennzeichnet, dass man die Hydrierung bei einer Temperatur von 30 bis 140°C durchführt.

10

15

20

25

30

35

40

45

GEÄNDERTES BLATT
IPEA/EP

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.